

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
27. Januar 2005 (27.01.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 2005/007157 A1

not Sk

(51) Internationale Patentklassifikation: A61K 31/4155,  
A61P 9/00, C07D 403/04, 409/14, 405/14, 401/14, 413/04,  
417/04, 403/14, 401/04, 417/14, 413/14

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/007227

(22) Internationales Anmeldedatum:  
2. Juli 2004 (02.07.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
103 31 951.4 15. Juli 2003 (15.07.2003) DE  
10 2004 010 545 4. März 2004 (04.03.2004) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von  
US): BAYER HEALTHCARE AG [DE/DE]; 51368 Lev-  
erkusen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): ALLERHEILI-  
GEN, Swen [DE/DE]; Beckumsfeld 4, 45259 Essen  
(DE). BROHM, Dirk [DE/DE]; Altenbergstr. 9, 58313  
Herdecke (DE). DIEDRICHS, Nicole [DE/DE]; Lau-  
rentiusstr. 12, 42103 Wuppertal (DE). FRÖHLEN,  
Britta-Nicole [DE/DE]; Ophovener Str. 59, 51375

Leverkusen (DE). GERDES, Christoph [DE/DE]; Chris-  
tian-Hess-Str. 81, 51373 Leverkusen (DE). GNOTH,  
Mark, Jean [DE/DE]; Am Hang 53, 40822 Mettmann  
(DE). HECKROTH, Heike [DE/DE]; August-Jung-Weg  
34, 42113 Wuppertal (DE). HÜBSCH, Walter [DE/DE];  
Wildsteig 22, 42113 Wuppertal (DE). PERZBORN, Elis-  
abeth [DE/DE]; Am Tescher Busch 13, 42327 Wuppertal  
(DE). STAHL, Elke [DE/DE]; Reuterstr. 124, 51467 Ber-  
gisch Gladbach (DE). VÖHRINGER, Verena [DE/DE];  
Am Hochsitz 17, 42113 Wuppertal (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER HEALTHCARE AG;  
Law and Patents, Patents and Licensing, 51368 Leverkusen  
(DE).

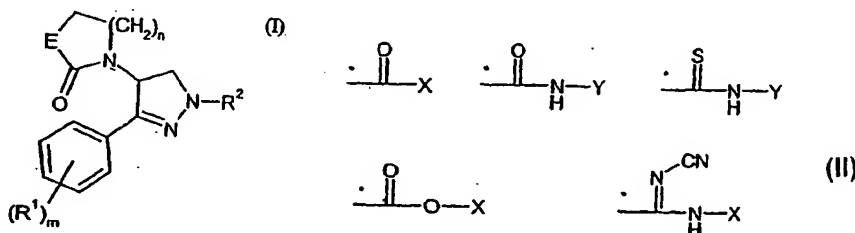
(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,  
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,  
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,  
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,  
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,  
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,  
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,  
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,  
ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: PYRAZOLINES AS PAR-1 ANTAGONISTS FOR TREATMENT OF CARDIOVASCULAR DISEASES

(54) Bezeichnung: PYRAZOLINE ALS PAR-1-ANTAGONISTEN ZUR BEHANDLUNG VON HERZ-KREISLAUF-ERKRAN-  
KUNGEN



(57) Abstract: The invention relates to pyrazolines of formula (I), where E = methylene, NH, O or S and R<sup>2</sup> = a group of formula (II), methods for the production and use thereof for the production of medicaments for the treatment and/or prophylaxis of diseases, in particular, cardiovascular diseases, such as thromboembolic diseases.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft Pyrazoline der Formel (I) in welcher E für Methylen, NH, ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom steht, R<sup>2</sup> für eine Gruppe der Formel (II) steht, und Verfahren zu ihrer Herstellung sowie ihre Verwendung zur Herstellung von Arzneimitteln zur Behandlung und/oder Prophylaxe von Krankheiten, insbesondere von Herz-Kreislauf-Erkrankungen, wie z.B. thromboembolischen Erkrankungen.

WO 2005/007157 A1

BEST AVAILABLE COPY



GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

Veröffentlicht:

— mit internationalem Rechenzeichenbericht

BEST AVAILABLE COPY